

(19) BUNDESREPUBLIK

DEUTSCHLAND

Patentschrift ⁽¹⁰⁾ DE 42 37 081 C 2

(5) Int. Cl.6: A 61 K 7/32



DEUTSCHES PATENTAMT (21) Aktenzeichen:

P 42 37 081.7-41

Anmeldetag:

3.11.92

43 Offenlegungstag:

5. 5.94

Veröffentlichungstag

der Patenterteilung:

9. 5.96

Innerhalb von 3 Monaten nach Veröffentlichung der Ertellung kann Einspruch erhoben werden

(73) Patentinhaber:

Beiersdorf AG, 20253 Hamburg, DE; Solvay Fluor und Derivate GmbH, 30173 Hannover, DE

2 Erfinder:

Wolf, Florian, Dr., 20251 Hamburg, DE; Klein, Winfried, Dr., 22297 Hamburg, DE; Siemanowski, Werner, Dr., 47495 Rheinberg, DE; Jakobson, Gerald, Dr., 47495 Rheinberg, DE; Uhlig, Karl-Heinz, 47802 Krefeld, DE; Dillenburg, Heimut, Dr., 47495 Rheinberg, DE

(56) Für die Beurteilung der Patentfähigkeit in Betracht gezogene Druckschriften:

> DE 3B 18 293 A1

> EP 04 33 132 A1

(A) Verwendung von Di- oder Triglycerinestern als Deowirkstoffe

Verwendung von Monocarbonsäureestern des Di- und/ oder Triglycerins zur Bekämpfung grampositiver, insbesondere coryneformer Bakterien oder zur Verhinderung deren Wachstums.

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung von Monocarbonsäureestern des Di- und/oder Triglycerins zur Bekämpfung grampositiver, insbesondere coryneformer Bakterien oder zur Verhinderung deren Wachstums. Dadurch kann der durch mikrobielle Zersetzung apokrinen Schweißes hervorgerufene menschliche Körpergeruch beseitigt werden. Den handelsüblichen kosmetischen Desodorantien liegen unterschiedliche Wirkprinzipien zugrunde.

In sogenannten Antitranspirantien kann durch Adstringentien — vorwiegend Aluminiumsalze wie Aluminiumhydroxychlorid (Aluchlorhydrat) — die Entstehung des Schweißes unterbunden werden. Abgesehen von der Denaturierung der Hautproteine greifen die dafür verwendeten Stoffe aber, abhängig von ihrer Dosierung, drastisch in den Wärmehaushalt der Achselregion ein und sollten allenfalls in Ausnahmefällen angewandt werden.

Durch die Verwendung antimikrobieller Stoffe in kosmetischen Desodorantien kann die Bakterienflora auf der Haut reduziert werden. Dabei sollten im Idealfalle nur die Geruch verursachenden Mikroorganismen wirksam reduziert werden. In der Praxis hat sich aber herausgestellt, daß die gesamte Mikroflora der Haut beeinträchtigt werden kann.

Der Schweißfluß selbst wird dadurch nicht beeinflußt, im Idealfalle wird nur die mikrobielle Zersetzung des Schweißes zeitweilig gestoppt.

Auch die Kombination von Adstringentien mit antimikrobiell wirksamen Stoffen in ein und derselben Zusammensetzung ist gebräuchlich. Die Nachteile beider Wirkstoffklassen lassen sich auf diesem Wege jedoch nicht vollständig beseitigen.

Schließlich kann Körpergeruch auch durch Duftstoffe überdeckt werden, eine Methode, die am wenigsten den ästhetischen Bedürfnissen des Verbrauchers gerecht wird, da die Mischung aus Körpergeruch und Parfümduft eher unangenehm riecht.

Allerdings werden die meisten kosmetischen Desodorantien, wie auch die meisten Kosmetika insgesamt, parfümiert, selbst wenn sie desodorierende Wirkstoffe beinhalten. Parfümierung kann auch dazu dienen, die Verbraucherakzeptanz eines kosmetischen Produktes zu erhöhen oder einem Produkt ein bestimmtes Flair zu geben.

Die Parfümierung wirkstoffhaltiger kosmetischer Zubereitungen, insbesondere kosmetischer Desodorantien, ist allerdings nicht selten problematisch, weil Wirkstoffe und Parfümbestandteile gelegentlich miteinander reagieren und einander unwirksam machen können.

Desodorantien sollen folgende Bedingungen erfüllen:

35

- 1) Sie sollen eine zuverlässige Desodorierung bewirken.
- 2) Die natürlichen biologischen Vorgänge der Haut dürfen nicht durch die Desodorantien beeinträchtigt werden.
- 3) Die Desodorantien müssen bei Überdosierung oder sonstiger nicht bestimmungsgemäßer Anwendung unschädlich sein.
- 4) Sie sollen sich nach wiederholter Anwendung nicht auf der Haut anreichern.
- 5) Sie sollen sich gut in übliche kosmetische Formulierungen einarbeiten lassen.

Bekannt und gebräuchlich sind sowohl flüssige Desodorantien, beispielsweise Aerosolsprays, Roll-ons und dergleichen als auch feste Zubereitungen, beispielsweise Deo-Stifte ("Sticks"), Puder, Pudersprays, Intimreinigungsmittel usw.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es also, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die die Nachteile des Standes der Technik nicht aufweisen. Insbesondere sollten die Desodorantien die Mikroflora der Haut weitgehend schonen, die Zahl der Mikroorganismen aber, die für den Körpergeruch verantwortlich sind, selektiv reduzieren.

Weiterhin war es eine Aufgabe der Erfindung, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, die sich durch gute Hautverträglichkeit auszeichnen. Auf keinen Fall sollten die desodorierenden Wirkprinzipien sich auf der Haut anreichern.

Eine weitere Aufgabe war, kosmetische Desodorantien zu entwickeln, welche mit einer möglichst großen Vielzahl an üblichen kosmetischen. Hilfs- und Zusatzstoffen harmonieren, insbesondere mit den gerade in desodorierend oder antitranspirierend wirkenden Formulierungen bedeutenden Parfümbestandteilen.

Noch eine weitere Aufgabe der Erfindung war, kosmetische Desodorantien zur Verfügung zu stellen, welche über einen längeren Zeitraum, und zwar in der Größenordnung von mindestens einem halben Tag, wirksam sind, ohne daß ihre Wirkung spürbar nachläßt.

Schließlich war eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, desodorierende kosmetische Prinzipien zu entwikkeln, die möglichst universell in die verschiedensten Darreichungsformen kosmetischer Desodorantien eingearbeitet werden können, ohne auf eine oder wenige spezielle Darreichungsformen festgelegt zu sein.

Es wurde überraschend gefunden, und darin liegt die Lösung all dieser Aufgaben, daß die Verwendung von Monocarbonsäureestern des Di- und/oder Triglycerins zur Bekämpfung grampositiver, insbesondere coryneformer Bakterien oder zur Verhinderung deren Wachstums den Nachteilen des Standes der Technik abhilft.

Zwar ist bekannt, daß Fettsäureester des Glycerins (also des Monoglycerins) gewisse antimikr bielle Wirkung zeitigen. Bekannt ist ferner, Monoglycerinfettsäureester in desodorierenden Kosmetika einzusetzen, insbesondere das Glycerinmonolaurat. Dennoch bleibt die Wirkung dieser Monoglycerinester weit hinter der der erfindungsgemäßen Monocarbonsäureester zurück.

Erfindungsgemäß liegen die Di- bzw. Triglycerineinheiten der Monocarbonsäureester als lineare, unverzweig-

te Moleküle, also über die jeweiligen OH-Gruppen in 1- bzw. 3-Stellung veretherte "Monoglycerinmoleküle" vor.

5

10

60

Ein geringer Anteil zyklischer Di- bzw. Triglycerineinheiten sowie über die OH-Gruppen in 2-Stellung veretherte Glycerinmoleküle kann geduldet werden. Es ist jedoch von Vorteil, solche Verunreinigungen so gering wie nur möglich zu halten.

Erfindungsgemäß sind die Monocarbonsäureester des Diglycerins vorzugsweise Monocarbonsäuremonoester und bevorzugt durch folgende Struktur gekennzeichnet (Substitutionspositionen angegeben):

wobei R' einen Kohlenwasserstoffrest, vorteilhaft einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenyl- 25 rest von 5 bis 17 C-Atomen darstellt.

Erfindungsgemäß sind die Monocarbonsäureester des Triglycerins vorzugsweise Monocarbonsäuremonoester und bevorzugt durch folgende Struktur gekennzeichnet (Substitutionspositionen angegeben):

wobei R" einen Kohlenwasserstoffrest, vorteilhaft einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest Alkylrest von 5 bis 17 C-Atomen darstellt.

Die diesen Estern zugrundeliegenden Säuren sind die

Hexansaure (Capronsaure) (R' bzw. R" = $-C_5H_{11}$), Heptansäure (Onanthsäure) (R' bzw. R" = $-C_6H_{13}$), Octansäure (Caprylsäure) (R' bzw. R" = $-C_7H_{15}$), Nonansäure (Pelargonsäure) (R' bzw. R" = $-C_8H_{17}$), 45 Decansaure (Caprinsaure) (R' bzw. R" = $-C_9H_{19}$), Undecansaure (R' bzw. R" = $-C_{10}H_{21}$), 10-Undecensäure (Undecylensäure) (R' bzw. R" = $-C_{10}H_{19}$), Dodecansäure (Laurinsäure) (R' bzw. R" = $-C_{11} H_{23}$), Tridecansäure (R' bzw. R" = $-C_{12}H_{25}$), 50 Tetradecansaure (Myristinsaure) (R' bzw. R" = $-C_{13}H_{27}$), Pentadecansaure (R' bzw. R" = $-C_{14}H_{29}$), Hexadecansaure (Palmitinsaure) (R' bzw. R" = $-C_{15}H_{31}$), Heptadecansäure (Margarinsäure) (R' bzw. R" = $-C_{16}H_{33}$), Octadecansaure (Stearinsaure) (R' bzw. R" = -C17H35). 55

Besonders günstig werden R' und R" gewählt aus der Gruppe der unverzweigten Alkylreste mit ungeraden C-Zahlen, insbesondere mit 9, 11 und 13 C-Atomen. Im allgemeinen sind die Ester des Diglycerins denen des Triglycerins bevorzugt. Ganz besonders günstig sind:

Diglycerinmonocaprinat (DMC) R' = 9
Triglycerinmonolaurat (TML) R' = 11
Diglycerinmonolaurat (DML) R' = 11
Triglycerinmonomyristat (TMM) R'' = 13.

Als erfindungsgemäß bevorzugter Monocarbonsäureester hat sich das Diglycerinmonocaprinat (DMC) er-

wiesen.

Erfindungsgemäß liegen die Monofettsäureester des Diglycerins bevorzugt in 1-Stellung, die Monofettsäuree-

ster des Triglycerins bevorzugt in 2'-Stellung verestert vor.

Nach einer vorteilhaften Ausführungsform der vorliegenden Erfindung wird ein zusätzlicher Anteil an in anderen Stellen verestertem Di- oder Triglycerin; ebenso wie gegebenenfalls ein Anteil an den verschiedenen Diestern des Di- bzw. Triglycerins verwendet.

Insbesondere vorteilhaft sind solche Monocarbonsäureester, welche nach einem Verfahren erhältlich sind, wie

es in der DE-OS 38 18 293 beschrieben wird.

Die Diglycerinester, welche sich durch zwei, und die Triglycerinester, welche sich durch drei Asymmetriezentren auszeichnen, sind in all ihren Konfigurationen erfindungsgemäß wirksam. Die Diglycerinester besitzen vier, die Triglycerinester acht Stereoisomere.

Bei den Diglycerinestern sind die 2- und die 2'-Position Asymmetriezentren. Erfindungsgemäß aktiv und

gleichermaßen von Vorteil sind die 2S2'S-, die 2R2'S-, die 2S2'R- und die 2R2'R-Konfiguration.

Bei den Triglycerinestern sind die 2-, die 2' und die 2"-Position Asymmetriezentren. Erfindungsgemäß aktiv und gleichermaßen von Vorteil sind die 2S2'S2"S-, die 2R2'S2"S-, die 2S2'R2"S-, die 2R2'R2"S-, die 2S2'S2"R, die 2R2'S2"R-, die 2S2'R2"R- und die 2R2'R2"R-Konfiguration.

Es hat sich als günstig herausgestellt, racemische Gemische der Stereoisomeren zu verwenden.

Nach einer vorteilhaften Ausführungsform der vorliegenden Erfindung werden Gemische eines oder mehrerer Monocarbonsäureester des Diglycerins mit einem oder mehreren Monocarbonsäureestern des Triglycerins

Nach einer weiteren vorteilhaften Ausführungsform der vorliegenden Erfindung werden ein oder mehrere Monocarbonsäureester des Diglycerins und/oder ein oder mehrere Monocarbonsäureester des Triglycerins in Kombination mit anderen in Kosmetika üblichen Wirkstoffen (Ersatzwirkstoffe), Hilfs-, Verschnitt- und/oder Zusatzstoffen eingesetzt.

Vorteilhaft liegen dann die Verschnittstoffe und/oder Ersatzwirkstoffe in einer Konzentration bis zu 50 Gew.-Teilen vor, bevorzugt bis zu 35 Gew.-Teilen, bezogen auf das 100 Gew.-Teile der Gesamtmenge, welche sich aus dem Monocarbonsäureester bzw. den Monocarbonsäureestern des Diglycerins und/oder des

Triglycerins und diesen Ersatzwirkstoffen und/oder Verschnittstoffen zusammensetzt.

Nach einer weiteren vorteilhaften Ausführungsform der vorliegenden Erfindung werden ein oder mehrere Monocarbonsäureester des Diglycerins und/oder ein oder mehrere Monocarbonsäureester des Triglycerins in Kombination mit anderen desodorierend oder das Wachstum von Bakterien hemmend oder Bakterien abtötend wirkenden Stoffen eingesetzt.

Nach noch einer weiteren vorteilhaften Ausführungsform der vorliegenden Erfindung werden ein oder mehrere Monocarbonsäureester des Diglycerins und/oder ein oder mehrere Monocarbonsäureester des Triglycerins in Kombination mit Monocarbonsaureestern des Glycerins (also des "Monoglycerins") eingesetzt. Dabei übernehmen diese Monocarbonsäureester des Glycerins die Rolle der Verschnittstoffe und/oder Ersatzwirkstoffe und werden vorzugsweise in einer Konzentration bis zu 50 Gew.-Teilen, bevorzugt bis zu 35 Gew.-Teilen eingesetzt, bezogen auf 100 Gew.-Teile der Gesamtmenge, welche sich aus dem Monocarbonsäureester bzw. den Monocarbonsäureestern des Diglycerins und/oder des Triglycerins und diesen Monocarbonsäureestern des Glycerins zusammensetzt.

Solche Monocarbonsäureester des Glycerins sind günstig gekennzeichnet durch eine Struktur wie folgt:

wobei R" einen Kohlenwasserstoffrest, vorteilhaft einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest von 5 bis 17 C-Atomen darstellt.

Die desodorierende Wirkung der erfindungsgemäß eingesetzten Ester beruht in erster Linie auf deren selektiver Toxizität für grampositive, insbesondere coryneforme Bakterien. Diese werden als die für die Zersetzung des apokrinen Schweißes hauptsächlich verantwortlichen Keime angesehen. Ferner sind die erfindungsgemäßen Ester gut wirksam gegen Staphylococcen.

Da die gemäßen Ester zugleich völlig unschädlich für den Menschen und andere Warmblüter sind, sind sie in idealer Weise für die Verwendung in kosmetischen Desodorantien geeignet.

Erfindungsgemäß ist demnach auch die Verwendung von Monocarbonsäureestern des Di- und/oder Triglyce-

rins als desodorierend wirkendes Prinzip für kosmetische Desodorantien. Erfindungsgemäß ist schließlich auch die Verwendung von Monocarbonsäureestern, insbesondere von Monocarbonsäuremonoestern, des Di- und/oder Triglycerins zur Bekämpfung grampositiver, insbesondere coryneformer Bakterien, beziehungsweise die Verwendung von Monocarbonsäureestern des Di- und/oder Triglycerins

zur Verhinderung des Wachstums grampositiver, insbesondere coryneformer Bakterien.

Entsprechend der erfindungsgemäßen Verwendung sind die Desodorantien besonders vorteilhaft dadurch gekennzeichnet, daß der oder die Monocarbonsäureester des Di- und/oder Triglycerins in Konzentrationen von 0,01-10,00 Gew.-%, bevorzugt 0,05-5,00 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,1-3,00 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung, vorliegt oder vorliegen.

Entsprechend der erfindungsgemäßen Verwendung können die kosmetischen Desodorantien in Form von Aerosolen, also aus Aerosolbehältern, Quetschflaschen oder durch eine Pumpvorrichtung versprühbaren Präparaten vorliegen oder in Form von mittels Roll-on-Vorrichtungen auftragbaren flüssigen Zusammensetzungen,

als Deo-Stifte (Deo-Sticks) und in Form von aus normalen Flaschen und Behältern auftragbaren W/O – oder O/W-Emulsionen, z. B. Crémes oder Lotionen. Weiterhin können die kosmetischen Desodorantien vorteilhaft in Form von desodorierenden Tinkturen, desodorierenden Intimreinigungsmitteln, desodorierenden Shampoos, desodorierenden Dusch- oder Badezubereitungen, desodorierenden Pudern oder desodorierenden Pudersprays vorliegen.

Als übliche kosmetische Trägerstoffe zur Herstellung der desodorierenden Zubereitungen gemäß der erfindungsgemäßen Verwendung können neben Wasser, Ethanol und Isopropanol, Glycerin und Propylenglykol hautpflegende Fett- oder fettähnliche Stoffe, wie Ölsäuredecylester, Cetylalkohol, Cetylstearylalkohol und 2-Octyldodecanol, in den für solche Präparate üblichen Mengenverhältnissen eingesetzt werden sowie schleimbildende Stoffe und Verdickungsmittel, z. B. Hydroxyethyl- oder Hydroxypropylcellulose, Polyacrylsäure, Polyvinylpyrrolidon, daneben aber auch in kleinen Mengen cyclische Silikonöle (Polydimethylsiloxane) sowie flüssige Polymethylphenylsiloxane niedriger Viskosiät.

Als Treibmittel für aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische Desodorantien gemäß der erfindungsgemäßen Verwendung sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, beispielsweise Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden 15 können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die vorliegende Erfindung geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FCKW).

Als Emulgatoren zur Herstellung der kosmetischen Desodorantien gemäß der erfindungsgemäßen Verwendung, welche vorteilhaft als flüssige Zubereitungen mittels einer Roll-on-Vorrichtung auf die gewünschten Hautbereiche aufgetragen werden sollen, und die in den Zubereitungen in geringer Menge, z. B. 2 bis 5 Gewichts.-%, bezogen auf die Gesamt-Zusammensetzung, verwendet werden können, haben sich nichtionogene Typen, wie Polyoxyethylen-Fettalkoholether, z. B. Cetostearylalkoholpolyethylenglykolether mit 12 bzw. 20 angelagerten Ethylenoxid-Einheiten pro Molekül, Cetostearylalkohol sowie Sorbitanester und Sorbitanester-Ethylenoxid-Verbindungen (z. B. Sorbitanmonostearat und Polyoxyethylensorbitanmonostearat) und langkettige höhermolekulare wachsartige Polyglykolether als geeignet erwiesen.

Zusätzlich zu den genannten Bestandteilen können den desodorierenden kosmetischen Zubereitungen gemäß der erfindungsgemäßen Verwendung, deren pH-Wert vorzugsweise z. B. durch übliche Puffergemische auf 4,0 bis 9,0 insbesondere 5,0 bis 6,5, eingestellt wird, Parfüm, Farbstoffe, Antioxidantien (z. B. α-Tocopherol und seine Derivate oder Butylhydroxytoluol (BHT = 2,6-Di-Tert.-butyl-4-methylphenol) in Mengen von 0,01 bis 0,03%, bezogen auf die Gesamtzusammensetzung), Suspendiermittel, Puffergemische oder andere übliche kosmetische Grundstoffe beigemischt werden.

Vorteilhaft wird der pH-Wert der Formulierungen gemäß der erfindungsgemäßen Verwendung im schwach sauren bis schwach alkalischen Bereich eingestellt, bevorzugt von 4,0-9,0, besonders bevorzugt von 5,0-6,5.

Die jeweils einzusetzenden Mengen an kosmetischen Trägerstoffen und Parfüm können in Abhängigkeit von der Art des jeweiligen Produktes vom Fachmann durch einfaches Ausprobieren leicht ermittelt werden.

Zur Parfümierung sind gegebenenfalls auch solche Substanzen und Parfümöle geeignet, die stabil sind, die Haut nicht reizen und bereits als solche antibakterielle oder bakteriostatische Eigenschaften besitzen.

Die Herstellung der kosmetischen Zubereitungen erfolgt abgesehen von speziellen Zubereitungen, die in den 40 Beispielen jeweils gesondert vermerkt sind, in üblicher Weise, zumeist durch einfaches Vermischen unter Rühren, gegebenenfalls unter leichter Erwärmung. Sie bietet keine Schwierigkeiten. Für Emulsionen werden Fettphase und die Wasserphase z. B. separat, gegebenenfalls unter Erwärmen hergestellt und dann emulgiert.

Ansonsten sind die üblichen Maßregeln für das Zusammenstellen von kosmetischen Formulierungen zu beachten, die dem Fachmann geläufig sind.

Sollen die Di- und/oder Triglycerinester gemäß der erfindungsgemäßen Verwendung in Pudersprays eingearbeitet werden, so können die Suspensionsgrundlagen dafür vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Kieselsäuregele (z. B. solche die unter dem Handelsnamen Aerosil® erhältlich sind), Kieselgur, Talkum, modifizierte Stärke, Titandioxid, Seidenpulver, Nylonpulver, Polyethylenpulver und verwandten Stoffen.

Es folgen vorteilhafte Ausführungsbeispiele der vorliegenden Erfindung.

Beispiel 1

Aerosolspray

(a) Flüssige Phase

| | Gew% | |
|---|-----------------------------------|----|
| Octyldodecanol DMC Parfüm Ethylalkohol | 0,50 0,50 q.s. ad 100,00 | 60 |

55

(b) Die unter (a) erhaltene flüssige Phase wird zusammen mit einem Propan/Butan 2,7-Gemisch im Verhältnis 39:61 in Aerosolbehälter abgefüllt.

Beispiel 2

Aerosolspray II

(a) Flüssige Phase

| | | Gew% |
|----|------------------|-----------|
| | Octyldodecanol | 0,50 |
| 10 | DMC | 0,20 |
| | Parfüm | q.s. |
| | Isopropylalkohol | ad 100,00 |
| | | |

(b) Die unter (a) erhaltene flüssige Phase wird zusammen mit einem Propan/Butan 2,7-Gemisch im Verhältnis 39:61 in Aerosolbehälter abgefüllt.

Beispiel 3

Corr 06

20 Pumpspray I

15

25

30

35

50

55

| | Gew70 |
|-----------------------------|------------|
| (a) Ethylalkohol | 60,00 |
| Glycerin | 1,00 |
| PEG-40-Hydriertes Ricinusöl | 2,00 |
| DMC | 0,50 |
| Parfum | q.s. |
| (b) Wasser | auf 100,00 |

Die unter (a) genannten Bestandteile werden zu einer homogenen Lösung verarbeitet, sodann langsam mit der Wasserphase (b) aufgefüllt. Der fertige Pumpspray kann sodann in Pumpzerstäuber abgefüllt werden.

Beispiel 4

Roll on — Gel I

| 40 | | Gew% |
|----|---|-----------|
| 40 | (a) 1,3-Butylenglycol | 2,00 |
| | Hydroxyethylcellulose (z. B. Tylose 4000, Hoechst) | 0,50 |
| | (b) Ethylalkohol | 60,00 |
| 45 | PEG-40-Hydriertes Ricinusöl | 2,00 |
| | DMC | 0,30 |
| | Parfum | q.s. |
| | (c) Wasser | ad 100,00 |

Die unter (a) genannten Bestandteile werden dispergiert, Wasser (c) wird zugegeben, bei Raumtemperatur quellen gelassen, eine Lösung der unter (b) genannten Bestandteile wird nach ca. 15 Minuten zugegeben. Die entstanden Mischung wird homogenisiert und kann abgefüllt werden.

Beispiel 5

Wachsstift I

| 60 | | Gew% |
|----|--------------------------------------|-----------|
| 60 | Hydriertes Ricinusöl | 5,00 |
| | Bienenwachs | 6,00 |
| | Ceresin (Hart-Ozokerit) | 30,00 |
| | C ₁₂₋₁₅ -Alkohol-Benzoate | 17,00 |
| 65 | DMC | 0,40 |
| | Parfum | q.s. |
| | Octyldodecanol | ad 100,00 |

Die Bestandteile werden bei ca. 75°C aufgeschmolzen, gut vermischt und in geeignete Formen gegossen.

Beispiel 6 Roll on — Emulsion I

| | Gew% | |
|--------------------------------------|-------|----|
| (a) Tricetearethphosphat | 0,30 | |
| Octyldodecanol | 2,00 | 10 |
| C ₁₂₋₁₅ -Alkohol-Benzoate | 2,00 | •• |
| DMC | 0.50 | |
| C ₁₀₋₃₀ -Alkylacrylate | 0,15 | |
| (b) Ethylalkohol | 10,00 | |
| Parfum | a.s. | 15 |

0,05

ad 100,00

Die unter (a) und (c) genannten Bestandteile werden jeweils unter Rühren auf 75°C erwärmt. Sodann werden die Bestandteile (a) zu (c) gegeben. Die Mischung wird auf 35°C abgekühlt. Aus den Bestandteilen (b) wird eine Lösung hergestellt, welche auf 35°C erwärmt wird und unter Rühren zur Mischung aus (a) und (c) gegeben wird.

(c) NaOH

Wasser

Beispiel 7

25

20

5

Aerosolspray IV

(a) Flüssige Phase

| | Gew% | 2 |
|---|-----------------------------------|----|
| Octyldodecanol TML Parfüm Isopropylalkohol | 0,50 0,20 q.s. ad 100,00 | 35 |
| | | |

(b) Die unter (a) erhaltene flüssige Phase wird zusammen mit einem Propan/Butan 2,7-Gemisch im Verhältnis 39: 61 in Aerosolbehälter abgefüllt.

Beispiel 8

Pumpspray Π

| | Gew% | 45 |
|--|-------------------------------|----|
| (a) Ethylalkohol Glycerin PEG-40-Hydriertes Ricinusöl TML Parfum (b) Wasser | 60,00 1,00 2,00 0,50 | 50 |
| | q.s. auf 100,00 | |

Die unter (a) genannten Bestandteile werden zu einer homogenen Lösung verarbeitet, sodann langsam mit der Wasserphase (b) aufgefüllt. Der fertige Pumpspray kann sodann in Pumpzerstäuber abgefüllt werden.

60

Beispiel 9

Roll on - Gel II

| 5 | | Gew% |
|----|--|-----------|
| | (a) 1,3-Butylenglycol | 2,00 |
| | Hydroxyethylcellulose (z. B. Tylose 4000, Hoechst) | 0,50 |
| 10 | (b) Ethylalkohol | 60,00 |
| | PEG-40-Hydriertes Ricinusöl | 2,00 |
| | TML | 0,30 |
| | Parfum | q.s. |
| 15 | (c) Wasser | ad 100,00 |

Die unter (a) genannten Bestandteile werden dispergiert, Wasser (c) wird zugegeben, bei Raumtemperatur quellen gelassen, eine Lösung der unter (b) genannten Bestandteile wird nach ca. 15 Minuten zugegeben. Die entstandene Mischung wird homogenisiert und kann abgefüllt werden.

Beispiel 10

Wachsstift II

| 25 | • | Gew% |
|----|--------------------------------------|-----------|
| | Hydriertes Ricinusöl | 5,00 |
| | Bienenwachs | 6,00 |
| | Ceresin (Hart-Ozokerit) | 30,00 |
| 30 | C ₁₂₋₁₅ -Alkohol-Benzoate | 17,00 |
| | TML | 0,40 |
| | Parfum | q.s. |
| | Octyldodecanol | ad 100,00 |

Die Bestandteile werden bei ca. 75°C aufgeschmolzen, gut vermischt und in geeignete Formen gegossen.

Beispiel 11

40 Roll on — Emulsion II

| | | Gew% |
|----|--------------------------------------|-----------|
| | (a) Tricetearethphosphat | 0,30 |
| 45 | Octyldodecanol | 2,00 |
| | C ₁₂₋₁₅ -Alkohol-Benzoate | 2,00 |
| | TML | 0,50 |
| | C ₁₀₋₃₀ -Alkylacrylate | 0,15 |
| 50 | (b) Ethylalkohol | 10,00 |
| 50 | Parfum | q.s. |
| | (c) NaOH | 0.05 |
| | Wasser | ad 100,00 |

Die unter (a) und (c) genannten Bestandteile werden jeweils unter Rühren auf 75°C erwärmt. Sodann werden die Bestandteile (a) zu (c) gegeben. Die Mischung wird auf 35°C abgekühlt. Aus den Bestandteilen (b) wird eine Lösung hergestellt, welche auf 35°C erwärmt wird und unter Rühren zur Mischung aus (a) und (c) gegeben wird.

.

60

55

20

35

Beispiel 12

Pumpspray III

| | Gew% | . 5 |
|-----------------------------|------------|-----|
| (a) Ethylaikohol | 60,00 | |
| Glycerin | 1,00 | |
| PEG-40-Hydriertes Ricinusöl | 2,00 | |
| DML | 0.50 | 10 |
| Parfum | .2.p | |
| (b) Wasser | auf 100,00 | |

Die unter (a) genannten Bestandteile werden zu einer homogenen Lösung verarbeitet, sodann langsam mit der 15 Wasserphase (b) aufgefüllt. Der fertige Pumpspray kann sodann in Pumpzerstäuber abgefüllt werden.

Beispiel 13

| Roll on — Gel III | | 20 |
|--|-----------------------------------|----|
| | Gew% | |
| (a) 1,3-Butylenglycol Hydroxyethylcellulose (z. B. Tylose 4000, Hoechst) (b) Ethylalkohol | 2,00 0,50 60,00 | 25 |
| PEG-40-Hydriertes Ricinusöl DML Parfum (c) Wasser | 2,00 0,30 q.s. ad 100,00 | 30 |

Die unter (a) genannten Bestandteile werden dispergiert, Wasser (c) wird zugegeben, bei Raumtemperatur quellen gelassen, eine Lösung der unter (b) genannten Bestandteile wird nach ca. 15 Minuten zugegeben. Die antstandene Mischung wird homogenisiert und kann abgefüllt werden.

Beispiel 14

| Wachsstift II | TI . | 40 |
|---|--|----|
| | Gew% | |
| Hydriertes Ricinusöl Bienenwachs Ceresin (Hart-Ozokerit) C ₁₂₋₁₅ -Alkohol-Benzoate DML Parfum Octyldodecanol | 5,00 6,00 30,00 17,00 0,40 | 45 |
| | q.s. ad 100,00 | 50 |

Die Bestandteile werden bei ca. 75°C aufgeschmolzen, gut vermischt und in geeignete Formen gegossen.

60

55

DE 42 37 081

Beispiel 15

Roll on - Emulsion III

| 5 | | Gew% |
|----|--------------------------------------|-----------|
| , | (a) Tricetearethphosphat | 0,30 |
| | Octyldodecanol | 2,00 |
| | C ₁₂₋₁₅ -Alkohol-Benzoate | 2,00 |
| 10 | DML | 0,50 |
| | C ₁₀₋₃₀ -Alkylacrylate | 0,15 |
| | (b) Ethylalkohol | 10,00 |
| 15 | Parfum | q.s. |
| | (c) NaOH | 0,05 |
| | Wasser | ad 100,00 |

Die unter (a) und (c) genannten Bestandteile werden jeweils unter Rühren auf 75°C erwärmt. Sodann werden die Bestandteile (a) zu (c) gegeben. Die Mischung wird auf 35°C abgekühlt. Aus den Bestandteilen (b) wird eine Lösung hergestellt, welche auf 35°C erwärmt wird und unter Rühren zur Mischung aus (a) und (c) gegeben wird.

Beispiel 16

Pumpspray IV

| • | Gew% |
|-----------------------------|------------|
| (a) Ethylalkohol | 60,00 |
| Glycerin | 1,00 |
| PEG-40-Hydriertes Ricinusöl | 2,00 |
| DMC | 0,20 |
| TML | 0,30 |
| Parfum | q.s. |
| (b) Wasser | auf 100,00 |

Die unter (a) genannten Bestandteile werden zu einer homogenen Lösung verarbeitet, sodann langsam mit der Wasserphase (b) aufgefüllt. Der fertige Pumpspray kann sodann in Pumpzerstäuber abgefüllt werden.

Der nachfolgend dargestellte Versuch soll die Überlegenheit der erfindungsgemäßen Monocarbonsäureester belegen.

Versuch:

25

30

35

Testorganismus: Corynebacterium xerosis

Eingesetzte Lösungen:

AG-Medium: 37 g Brain Heart Infusion, 5 g Glucose, 1 ml Tween 80 ad 1 l H₂O
Testsubstanz 1: Glycerinmonolaurat (GML) (Vergleichssubstanz gemäß dem Stande der Technik)

Testsubstanz 2: Diglycerinmonocaprinat (DMG)

Kontrolle: AC-Medium ohne Wirkstoff

Testlösungen: 4 mMol der jeweiligen Testsubstanz in AG-Medium.

50 ml AG-Medium wurden mit 0,2 ml einer frischen Übernachtkultur des Testorganismus Corynebacterium xerosis (C. xerosis) beimpft. Das Kulturgefäß wurde bei 30°C mit 250 Upm geschüttelt, bis eine Zelldichte von 105 bis 106 Zellen/ml erreicht war.

Die Testsubstanzen wurden eingewogen, mit 5 ml AC-Medium versetzt und durch ca. 10minütiges Erwärmen auf 60°C gelöst.

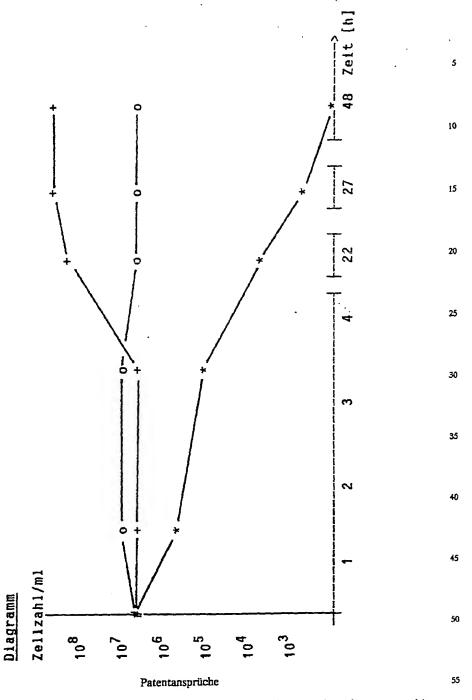
Anschließend wurden 5 ml-Aliquots der Bakteriensuspension mit den so gewonnenen Testlösungen versetzt und unter Beibehaltung der Wachstumsbedingungen zu verschiedenen Zeitpunkten Proben entnommen und deren Bakterientiter durch Ausplattieren von Verdünnungen auf Nährmedien bestimmt.

Im Diagramm sind die Wachstumskurven für die vorabbeschriebenen Versuchsansätze aufgezeigt. Es bedeu-

- -O-:Testlösung 1
- -*-: Testlösung 2
- -+-: Kontrolle (Wirkstoff-freies AC-Medium)

65

60



1. Verwendung von Monocarbonsäureestern des Di- und/oder Triglycerins zur Bekämpfung grampositiver,

3. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß das Diglycerin in 1-Stellung und/oder das Triglycerin in 2'-Stellung mit Carbonsäuren verestert vorliegt.

4. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Monocarbonsäureester des Diglycerins

insbesondere coryneformer Bakterien oder zur Verhinderung deren Wachstums.

2. Verwendung nach Anspruch 1 zur Bekämpfung des durch mikrobielle Zersetzung apokrinen Schweißes hervorgerufenen menschlichen Körpergeruches.

Monocarbonsäuremonoester darstellen und durch folgende Strukturen gekennzeichnet sind:

wobei R' einen Kohlenwasserstoffrest, vorteilhaft einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest von 5 bis 17 C-Atomen darstellt.

5. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß die Monocarbonsäureester des Triglycerins Monocarbonsäuremonoester darstellen und durch folgende Strukturen gekennzeichnet sind:

wobei R" einen Kohlenwasserstoffrest, vorteilhaft einen verzweigten oder unverzweigten Alkyl- oder Alkenylrest von 5 bis 17 C-Atomen darstellt.

6. Verwendung nach Anspruch 4 oder 5, dadurch gekennzeichnet, daß R' und/oder R" gewählt werden aus der Gruppe der unverzweigten Alkylreste mit ungeraden C-Zahlen, insbesondere mit 9, 11 und 13 C-Atomen, bevorzugt aus der Gruppe:

Diglycerinmonocaprinat (DMC) R' = 9
Triglycerinmonolaurat (TML) R" = 11
Diglycerinmonolaurat (DML) R' = 11
Triglycerinmonomyristat (TMM) R" = 13,

besonders bevorzugt Diglycerinmonocaprinat, gewählt wird.
7. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der oder die Monocarbonsäureester des Diund/oder Triglycerins in Konzentrationen von 0,01—10,00 Gew.-%, bevorzugt 0,05—5,00 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,1—3,00 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung, vorliegt oder vorliegen.